

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

2 PN="JP 88041363"  
?t s1/5/all

1/5/1 (Item 1 from file: 351)  
DIALOG(R) File 351:Derwent WPI  
(c) 2002 Thomson Derwent. All rts. reserv.

003924840  
WPI Acc No: 1984-070384/198412  
XRAM Acc No: C84-030078

Hair growth promoting aliphatic carboxylic acid - contains odd number of carbon atoms and may be deriv. such as ester, amide or imide

Patent Assignee: LION CORP (LIOY )

Inventor: ADACHI K; SADAI M; TAMAI H

Number of Countries: 014 Number of Patents: 009

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week	
EP 102534	A	19840314	EP 83107703	A	19830804	198412	B
JP 59027809	A	19840214	JP 82137909	A	19820810	198412	
AU 8317502	A	19840216				198414	
CA 1223212	A	19870623				198729	
JP 88041363	B	19880817				198836	
US 4874791	A	19891017	US 86923902	A	19861028	198951	
US 4978681	A	19901218	US 88232770	A	19880816	199102	
EP 102534	B	19911113				199146	
DE 3382458	G	19911219				199201	

Priority Applications (No Type Date): JP 82137909 A 19820810

Cited Patents: 1.Jnl.Ref; A3...8535; DE 2913040; FR 2236484; JP 54129135;  
No-SR.Pub; 1.Jnl.REF

Patent Details:

Patent No Kind Lan Pg Main IPC Filing Notes

EP 102534 A E 23

Designated States (Regional): AT BE CH DE

EP 102534 B

Designated States (Regional): AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

Abstract (Basic): EP 102534 A

Agent contains an aliphatic carboxylic acid, or its deriv. having an odd number of carbon atoms. Pref. acid (deriv.) is n-propionic acid, n-valeric acid, n-nonanoic acid, n-heptanoic acid, n-hendecanoic acid, n-tridecanoic acid, n-pentadecanoic acid, n-heptadecanoic acid, n-nonadecanoic acid, n-heneicosanoic acid, n-tricosanoic acid, n-pentacosanoic acid or their triglyceride derivs.

Agent exhibits a strong hair-growing effect.

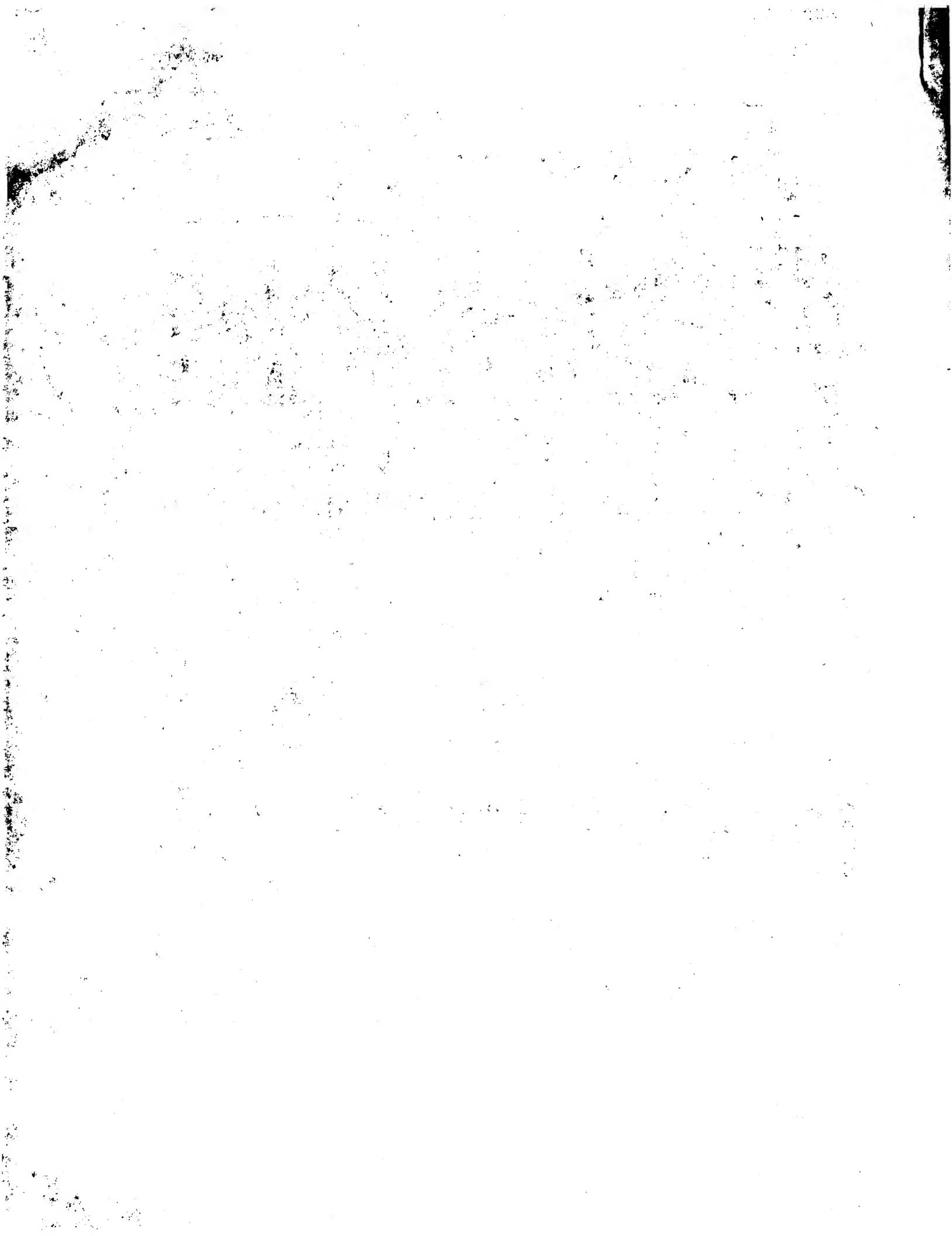
0/0

Title Terms: HAIR; GROWTH; PROMOTE; ALIPHATIC; CARBOXYLIC; ACID; CONTAIN; ODD; NUMBER; CARBON; ATOM; DERIVATIVE; ESTER; AMIDE; IMIDE

Derwent Class: D21; E17

International Patent Class (Additional): A61K-007/06; A61K-031/20

File Segment: CPI



# 採用

① 日本国特許庁 (JP)

② 特許出願公告

③ 特許公報 (B2)

昭63-41363

④ Int.CI.

A 61 K 7/06

識別記号

府内整理番号

7430-4C

⑤ 公告

昭和63年(1988)8月17日

16

発明の数 1 (全 9 頁)

⑥ 発明の名称 養毛剤

⑦ 特願 昭57-137909

⑧ 公明 昭59-27809

⑨ 出願 昭57(1982)8月10日

⑩ 昭59(1984)2月14日

⑪ 発明者 足立 邦明 神奈川県小田原市曾比2234米山コーポ14号

⑫ 発明者 玉井 秀夫 神奈川県中郡二宮町富士見丘2の25の22

⑬ 発明者 定井 正直 神奈川県平塚市札場町39の3

⑭ 出願人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号

⑮ 代理人 弁理士 鈴江 武彦 外2名

審査官 竹林 則幸

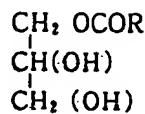
⑯ 参考文献 英国特許1469988 (GB, A)

養毛剤

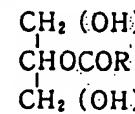
⑰ 特許請求の範囲

1 炭素原子数3~25の奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸又はその誘導体を有効成分として10重量以下含有する養毛剤であつて、前記誘導体は、  
イ 下記一般式〔I〕又は〔II〕で示されるモノ  
グリセライド、

〔I〕



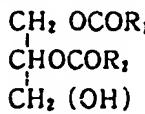
〔II〕



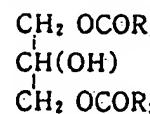
(ただし、Rは偶数の炭素鎖長を有する脂肪族炭化水素基を表わす)

ロ 下記一般式〔III〕又は〔IV〕で示されるジグリセライド、

〔III〕



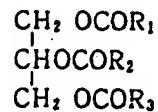
〔IV〕



(ただし、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は脂肪族炭化水素基であつて、これらのうち少なくとも一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式脂肪族炭化水素基を表わす)

ハ 下記一般式〔V〕で示されるトリグリセライド、

〔V〕



(ただし、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は脂肪族炭化水素基であつて、これのうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式脂肪族炭化水素基を表わす)

ニ 下記一般式〔VI〕で示される脂肪酸塩、

〔VI〕



(ただし、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式脂肪族炭化水素基、Mは金属原子又はアンモニウムイオン、nはMの価数に対応した整数を表わす)

ホ 下記一般式〔VII〕で示されるエステル、

〔VII〕



(ただし、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式脂肪族炭化水素基、R'は炭素原子数が偶数の1価若しくは2価の脂肪族アルコール残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基、又はショ糖残基を表わす)

ヘ 下記一般式〔VIII〕で表わされる第1アミド〔VIII〕



角、紫根エキス等の抗炎症剤、エラストジオールなどの女性ホルモン剤、セファランチンなどの皮膚機能亢進剤、パントテン酸鉄などのメラニン合成触媒剤、サリチル酸などの角質溶解剤などが配合され、脱毛症の予防及び治療に用いられている。

脂肪酸又はその誘導体が養毛剤等の毛髪化粧料に配合された例としては、オリーブ油、ヒマシ油等の天然植物油あるいはステアリン酸を製品の物性を改善する目的で配合した例が知られている。植物油や動物油等、天然に存在する各種脂質の構成脂肪酸はステアリン酸、パルミチン酸の様な飽和脂肪酸であつても、オレイン酸、リノール酸の様な不飽和脂肪酸であつても、そのほとんど全てが偶数の炭素鎖長を有する脂肪酸である。従つて、炭素数が奇数の脂肪酸又はその誘導体を毛髪化粧料に配合した例は知られていない。

従来の養毛剤は、フケ、カュミ、抜毛などの予防及び改善に有効で、発毛や育毛を促すとされているが、いまだ満足すべき効果を發揮するものは得られていない。

この発明の目的は、高い育毛効果を有する養毛剤を提供することである。

すなわち、この発明は、奇数鎖長の脂肪酸又はその誘導体を有効成分とする養毛剤を提供する。

脱毛症は種々の原因で起こり得るが、いずれの場合にも、結果的には頭髪が正常なヘアサイクルを営み得ず、休止期 (Telogen) の状態に達する。脱毛状態を改善し、発毛を促すためには休止期の毛包を正常な成長期 (Anagen.) にすることが必要である。そこで、本発明者らは休止期毛の成長期毛への変換に関する研究を鋭意行なった結果、奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸及びその誘導体が優れた養毛効果を有することを発見した。奇数鎖長の脂肪酸及びその誘導体が優れた改善効果を有する理由として考えられることは、第1に脂溶性であるため、皮脂腺から分泌され毛包と共存する皮脂に容易に溶け込み、毛根へ浸透しやすいため、第2に、ホスホラクトキナーゼを介して分解代謝されないため、ホルモンの作用を直接受けない、すなわちホルモンの作用により生じている脱毛症に対して有効であること、第3に、エネルギー産生効率が極めて優れている事である。

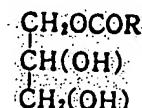
この発明の養毛剤に用いられる脂肪酸は、炭素

鎖を構成している炭素原子の数が奇数のものであれば、饱和脂肪酸であつても不饱和脂肪酸であつてもかまわない。不饱和脂肪酸は複数の二重結合を含んでいてもよい。また、プロピオン酸 (炭素鎖長3) や古草酸 (炭素鎖長5) のような低級脂肪酸でも、ベンタデカン酸 (炭素鎖長15) やヘptaデカン酸 (炭素鎖長17) のような高級脂肪酸でもよい。

この発明の養毛剤には、このような奇数鎖長の脂肪酸のいずれの誘導体をも用いることができる。ただし、人体に悪影響を及ぼすものを用いることができないことは言うまでもない。好ましい誘導体の例として次のものがあげられる。

イ 下記一般式〔I〕又は〔II〕で示されるモグリセライド。

〔I〕



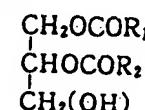
〔II〕



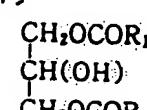
ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。

ロ 下記一般式〔III〕又は〔IV〕で示されるジグリセライド。

〔III〕



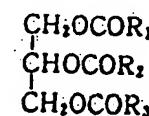
〔IV〕



ここで、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は少なくともいずれか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。R<sub>1</sub>又はR<sub>2</sub>のいずれか一方が偶数の炭素鎖長を有する鎖式有機基であればこの発明の効果は得られ、他の方は奇数の炭素鎖長を有する鎖式有機基であつてもよい。しかしながら、奇数鎖長の脂肪酸のジグリセライドであることが特に好ましい。

ハ 下記一般式〔V〕で示されるトリグリセライド

〔V〕



7

ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 及び $R_3$ のうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。 $R_1$ 、 $R_2$ 及び $R_3$ のうち少なくともいずれか1つが偶数の炭素鎖長を有する鎖式有機基であればこの発明の効果は得られ、他のものは奇数の炭素鎖長を有する鎖式有機基であってもかまわない。しかしながら、奇数鎖長の脂肪酸のトリグリセライドが特に好ましい。

## ニ 下記一般式〔VI〕で示される脂肪酸塩

〔VI〕



ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、Mは金属原子、nはMの価数に対応した整数を表わす。代表的なものは $RCOONa$ 、 $RCOOK$ 、及び $RCOOLi$ などである。

## ホ 下記一般式〔VII〕で示されるエステル

〔VII〕



ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、R'は炭素原子数が偶数の1価若しくは2価の脂肪族アルコール残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基、又はショ糖残基を表わす。1価アルコールの典型例はメタノール及びエタノールであり、アミノ残基の典型例はモノ、ジ、トリエタノールアミンである。

## ヘ 下記一般式〔VIII〕で表わされる第1アミド

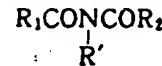
〔VIII〕



ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。R'及びR''は水素又は人体に悪影響を与えることがない有機基を表わす。

## ト 下記一般式〔IX〕で表わされる第2アミド

〔IX〕



ここで、 $R_1$ 及び $R_2$ のうち少なくともどちらか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。 $R_1$ 及び $R_2$ のうち少なくとも一方が偶数鎖長の有機基であればこの発明の効果を得ることができ、他のもの及びR'は人体に悪影響を与えないものであればどのような有機基であってもよい。もつとも、双方とも偶数鎖長の直鎖式有機基であることが特に好ましい。

8

 $R'$ は水素であつてもよい。

チ 下記一般式〔X〕で表わされる第3アミド。

〔X〕



ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 及び $R_3$ のうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。 $R_1$ 、 $R_2$ 及び $R_3$ のうち少なくとも1つが偶数鎖長の有機基であればこの発明の効果を得ることができ、他のものは人体に悪影響を与えないものであればどのような有機基であってもよい。もつとも、これら3つともが偶数鎖長の直鎖式有機基であることが特に好ましい。

リ 下記一般式〔XI〕で表わされる二塩基酸及びその塩

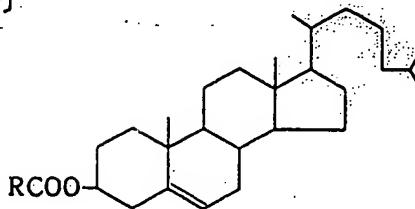
〔XI〕



ここで、Rは奇数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。

ヌ 下記一般式〔XII〕で表わされるステロールエステル

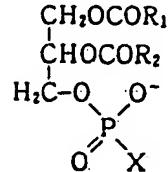
〔XII〕



ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。

ル 下記一般式〔XIII〕で表わされるリン脂質

〔XIII〕

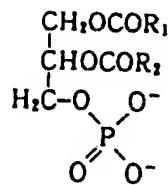


ここで、 $R_1$ 及び $R_2$ は鎖式有機基であつて、これらのうち少なくともいずれか一方、特に好ましくは双方とも偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。Xはコリン残基、エクノ-

ルアミン残基、セリン残基、又はイノシトール残基を表わす。Xがコリン残基のときはフォスファチジルコリン、エタノールアミン残基のときはフォスファチジルエタノールアミン、セリン残基のときはフォスファチジルセリン、イノシトールのときはフォスファチジルイノシトルとなる。

ヲ 下記一般式(XIV)で表わされるフォスファチジン酸

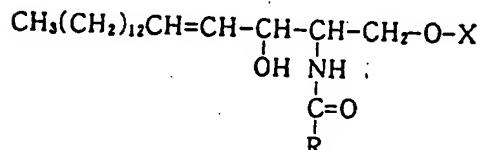
(XIV)



ここで、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は鎖式有機基であつて、これらのうち少なくともどちらか一方、特に好ましくは双方とも偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす。

ワ 下記一般式(XV)で表わされるスフィンゴ脂質

(XV)



ここで、Rは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、Xは醇残基、リン酸残基、又はコリン若しくはエタノールアミンのようなアミン塩基残基を表わす。

奇数鎖長の脂肪酸及びその誘導体の育毛効果を試験した。

試験した物質は、各種鎖長の奇数鎖長及び偶数鎖長の脂肪酸並びにこれらのトリグリセライド及び各種の誘導体である。被験試料はこれらの被験物質をエタノールに溶解して調製した。被験物質の濃度は0.3、1.0、3.0、又は10.0重量%である。さらに、被験物質を含まないエタノールも対照として試験した。

体重約2.5kgのニュージーランドホワイト種雄

15 ウナギ6ないし8羽を一群とし、背部を除毛し、休止期にあるもののみを実験に供した。休止期にあるものの除毛した背部に被験試料を各0.2mlずつ、週2回、30ないし60日間塗布し、休止期毛が成長期毛に変換するのに要する日数を調べた。結果を第1表に示す。なお、第1表中、「促進日数」とは、被験物質を含まないエタノールを塗布した場合に比べて、休止期毛から成長期毛への変換が何日間促進されたかを示すものである。

第一表

被験物質	濃度 (重量%)	育毛効果	
		促進日数	総合判定
プロピオン酸	0.3	10	有効
吉草酸	//	12	//
ヘプタン酸	//	12	//
ノナン酸	//	14	//
ヘンデカン酸	//	18	//
トリデカン酸	//	20	//
ペンタデカン酸	//	22	//
ヘプタデカン酸	//	22	//

被験物質	濃度 (重量%)	育毛効果	
		促進日数	総合判定
ノナデカン酸	//	16	//
ヘンエイコ酸	//	12	//
トリコサン酸	//	12	//
ペンタコサン酸	//	12	//
醋酸	//	2	無効
カプロン酸	//	1	//
カブリル酸	//	3	//
カブリリン酸	//	3	//
ラウリン酸	//	1	//
ミリストン酸	//	0	//
バルミチン酸	//	0	//
ステアリン酸	//	0	//
アラキン酸	//	0	//
ベヘン酸	//	0	//
リグノセリン酸	//	0	//
トリプロピオニン	3.0	10	有効
トリベンタノイン	//	16	//
トリヘプタノイン	//	20	//
トリノナノイン	//	22	//
トリヘンデカノイン	//	26	著効
トリトリデカノイン	//	28	//
トリベンタデカノイン	//	30	//
トリヘプタデカノイン	//	30	//
トリノナデカノイン	//	22	有効
トリヘンエイコサノイン	//	18	//
トリトリコサノイン	//	16	//
トリブチリン	//	2	無効
トリカプロン	//	2	//
トリカプリン	//	4	//
トリカブリリン	//	2	//
トリラウリン	//	0	//

被験物質	濃度 (重量%)	育毛効果	
		促進日数	総合判定
トリミリスチン	//	0	//
トリバルミチン	//	0	//
トリステアリン	//	0	//
トリアラキン	//	0	//
トリベヘン	//	0	//
トリリグノセリン	//	0	//
トリプロピオニン	10.0	12	有効
トリベンタノイン	//	16	//
トリヘプタノイン	//	20	//
トリノナノイン	//	24	//
トリヘンデカノイン	//	28	著効
トリトリデカノイン	//	28	//
トリベンタデカノイン	//	32	//
トリヘプタデカノイン	//	32	//
トリノナデカノイン	//	24	有効
トリヘンエイコサノイン	//	18	//
トリトリコサノイン	//	18	//
トリブチリン	//	3	無効
トリカブロン	//	2	//
トリカブリン	//	4	//
トリカブリリン	//	4	//
トリラウリン	//	2	//
トリミリスチン	//	0	//
トリバルミチン	//	0	//
トリステアリン	//	0	//
トリアラキン	//	0	//
トリベヘン	//	0	//
トリグノセリン	//	0	//
モノベンタデカノイン	1.0	30	著効
ジベンタデカノイン	//	26	//
トリベンタデカノイン	//	28	//
トリヘンデカノイン	//	22	有効

被験物質	濃度 (重量%)	育毛効果	
		促進日数	総合判定
トリトリデカノイン	//	28	著効
ペンタデカン酸ナトリウム	//	16	有効
〃 モノエタノールアミン塩	//	14	//
〃 トリエタノールアミン塩	//	14	//
〃 カルシウム	//	10	//
〃 メチルエステル	//	20	//
〃 エチルエステル	//	20	//
〃 イソノコビルエステル	//	22	//
〃 ヘキサデカノールエステル	//	16	//
〃 グリコールモノエステル	//	16	//
〃 ポリオキシエチレンエステル( $\bar{p}=9$ )	//	14	//
ペンタデカン酸ソルビタンモノエステル	//	12	//
〃 〃 ジエステル	//	14	//
〃 ショ糖モノエステル	//	16	//
〃 ジエタノールアミド(第1アミド)	//	14	//
ジペンタデカン酸モノエタノールアミド(第2アミド)	//	14	//
モノペンタデカン酸ジドデカン酸アミド(第3アミド)	//	12	//
アゼライン酸	//	10	//
ペンタデカン酸コレステロールエステル	//	18	//
〃 ホスフアチジルコリン	//	16	//
ペンタデカン酸ホスフアチジルモノエタノールアミンエステル	//	14	//
〃 ホスフアチジン酸	//	16	//
ペンタデカン酸スフィゴ脂質	//	12	//

この表より、偶数鎖長の脂肪酸及びそのグリセライドは育毛効果を有していないにもかかわらず、同程度の鎖長を有する奇数鎖長の脂肪酸及びそのグリセライド等の誘導体は顕著な育毛効果を有していることがわかる。

この発明の養毛剤は、常法に従つて、養毛料、ヘアトニック、ヘアローション、ヘアクリーム、シャンプー、リンスなど種々の形態として用いることができる。この発明の養毛剤の有効成分以外の成分は、通常これらの製造に用いられるものでよく、例えば基剤として蒸留水、アルコール類、多価アルコール類、界面活性剤、油脂類などが配合され、さらに薬効成分としてビタミン類、ホルモン類、血管拡張剤、アミノ酸類、抗炎症剤、皮膚機能亢進剤、角質溶解剤などの既知の養毛剤をも同時に配合し得る。

次に、この発明の実施例として、この発明の養毛剤の種々の形態をその組成(重量%)とともに示す。

#### 実施例1 養毛料

成 分	含量(重量%)
80%エタノール	88
n-トリヘンデカノイン	10.0
ヒマシ油	1.0
ピロリドンカルボン酸	0.5
香料	0.5

#### 実施例2 養毛料

成 分	含量(重量%)
85%エタノール	97.5
n-ノナン酸	0.5
オリーブ油	1.0
α-トコフェロール	0.5

17

香料	0.5	流動バラフイン	1.0
実施例3 養毛料		トリヘンデカノイン	3.0
成 分	含量(重量%)	精製水	90.5
90%エタノール	92.5	実施例7 ヘアクリーム	
n-トリトリデカノイン	5.0	成 分	含量(重量%)
オリーブ油	1.0	n-トリベンタデカノイン	10.0
グリチルリチン	1.0	オリーブ油	5.0
香料	0.5	流動バラフイン	51.0
実施例4 養毛料		ミツロウ	1.0
成 分	含量(重量%)	ソルビタンセスキオレート	3.0
90%エタノール	89.5	精製水	30.0
n-トリデカン酸エチル	3.0	実施例8 ヘアトニック	
流動バラフイン	5.0	成 分	含量(重量%)
ポリエナレンギリコール	2.0	n-ノナン酸エチル	3.0
香料	0.5	トウガラシチンキ	0.5
実施例5 シャンプー		ヒノキチオール	0.1
成 分	含量(重量%)	α-トコフェロール	0.3
ラウリルエーテル硫酸ナトリウム	5.0	ヒマシ油	10.0
α-オレフィンスルホン酸ナトリウム	10.0	エチルアルコール	86.1
ラウリル硫酸トリエタノールアミン	5.0	20 この発明の養毛剤を脱毛症患者に使用したところ、幅広い脱毛症に対して有効であり、特に若年性脱毛症、壮年性脱毛症などの男性型脱毛症、及び円形脱毛症に優れた育毛効果を示すことが明らかとなつた。	
n-トリトリデカノイン	3.0	25 また、この発明の養毛剤を使用することによる副作用は全く認められない。上述した実施例の養毛剤を、健常人25名に対してクニーズドバツチテストによる皮膚刺激性試験を行なつたところ、結果はいずれも陰性であつた(陽性率0%)。	
精製水	77.0	30 この様に本発明にかかる有効成分はいずれも安全性の高いものである。	
実施例6 ヘアリンス			
成 分	含量(重量%)		
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	1.5		
塩化ジステアリルジメチルアンモニウム	0.5		
セタノール	1.5		
ポリオキシエチレンステアリルエーテル (P=5)	2.0		

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**